

**Family list**

12 family members for:

**WO9633973**

Derived from 10 applications.

- 1 **1,4-DISUBSTITUIERTE PIPERIDINDERIVATE**  
Publication info: **AT269305T T** - 2004-07-15
- 2 **1,4-disubstituted piperidine derivatives**  
Publication info: **AU700837 B2** - 1999-01-14
- 3 **1,4-disubstituted piperidine derivatives**  
Publication info: **AU5513996 A** - 1996-11-18
- 4 **1,4-DI-SUBSTITUTED PIPERIDINE DERIVATIVES**  
Publication info: **CA2218479 A1** - 1996-10-31
- 5 **1,4-DISUBSTITUTED PIPERIDINE DERIVATIVES**  
Publication info: **DE69632728D D1** - 2004-07-22
- 6 **1,4-DISUBSTITUTED PIPERIDINE DERIVATIVES**  
Publication info: **DE69632728T T2** - 2004-10-14
- 7 **1,4-DISUBSTITUTED PIPERIDINE DERIVATIVES**  
Publication info: **EP0823423 A1** - 1998-02-11  
**EP0823423 A4** - 1998-09-02  
**EP0823423 B1** - 2004-06-16
- 8 **No English title available**  
Publication info: **JP2993124B2 B2** - 1999-12-20
- 9 **1,4-di-substituted piperidine derivatives**  
Publication info: **US5750540 A** - 1998-05-12
- 10 **1,4-DISUBSTITUTED PIPERIDINE DERIVATIVES**  
Publication info: **WO9633973 A1** - 1996-10-31

*Already  
Cited*

---

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

B14

世界知的所有権機関

国際事務局

PCT

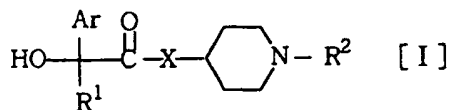
特許協力条約に基づいて公開された国際出願



<p>(51) 国際特許分類6 C07D 211/46, 211/58, 401/12, 405/12, 409/12, 417/12, A61K 31/445, 31/505 // (C07D 401/12, 211:00, 213:00) (C07D 401/12, 211:00, 235:00) (C07D 401/12, 207:00, 211:00) (C07D 401/12, 211:00, 239:00) (C07D 405/12, 211:00, 307:00) (C07D 409/12, 211:00, 333:00) (C07D 417/12, 211:00, 277:00)</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO96/33973</p> <p>(43) 国際公開日 1996年10月31日 (31.10.96)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP96/01128 (22) 国際出願日 1996年4月25日 (25.04.96)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平7/129827 1995年4月28日 (28.04.95) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP] 〒103 東京都中央区日本橋本町2丁目2番3号 Tokyo, (JP)</p> <p>(72) 発明者: および (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 土谷 義己 (TSUCHIYA, Yoshimi) [JP/JP] 野本 貴史 (NOMOTO, Takashi) [JP/JP] 大沢 浩一 (OHSAWA, Hirokazu) [JP/JP] 川上 久美子 (KAWAKAMI, Kumiko) [JP/JP] 大脇 健二 (OHWAKI, Kenji) [JP/JP] 錦辺 優 (NISHIKIBE, Masaru) [JP/JP] 〒300-33 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki, (JP)</p>	<p>(81) 指定国 AU, CA, CN, JP, KR, US, 欧州特許 (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>	
<p>(54) Title : 1,4-DISUBSTITUTED PIPERIDINE DERIVATIVES</p> <p>(54) 発明の名称 1,4-ジ置換ピペリジン誘導体</p> <p>(57) Abstract</p> <p>Novel 1,4-disubstituted piperidine derivatives represented by general formula (I) and pharmaceutically acceptable salts thereof, wherein Ar represents phenyl wherein one or two arbitrary hydrogen atoms on its ring may be substituted by substituent(s) selected from the group consisting of halogeno and lower alkyl or an aromatic 5- or 6-membered heterocycle having one or two heteroatoms selected from the group consisting of oxygen, nitrogen and sulfur; R<sup>1</sup> represents C<sub>3-6</sub> cycloalkyl or C<sub>3-6</sub> cycloalkenyl; R<sup>2</sup> represents saturated or unsaturated aliphatic C<sub>5-15</sub> hydrocarbon group; and X represents O or NH. The compounds have a selective antagonism against the muscarine M<sub>3</sub> receptor and a high safety with little side effect. Thus they are useful in the treatment or prevention of respiratory diseases such as asthma, chronic respiratory obstruction and pulmonary fibrosis, urological diseases accompanied with urination disorders such as frequent urination, urgency of micturition and urinary incontinence and digestive diseases such as convulsion or motion hyperenergia of the digestive tracts and irritable large intestine.</p> <div style="text-align: center;"> <p style="text-align: right;">(I)</p> </div>		

## (57) 要約

本発明は、一般式



[式中、Arは環上の任意の1～2個の水素原子がハロゲン原子および低級アルキル基よりなる群から選ばれる置換基で置換されていてもよいフェニル基、または酸素原子、窒素原子及び硫黄原子よりなる群から選ばれる1～2個のヘテロ原子を有する5または6員のヘテロ芳香環基を表し、R<sup>1</sup>は炭素数3～6個のシクロアルキル基または炭素数3～6個のシクロアルケニル基を表し、R<sup>2</sup>は炭素数5～15個の飽和または不飽和の脂肪族炭化水素基を表し、そしてXはOまたはNHを表す]で示される新規な1, 4-ジ置換ピペリジン誘導体及び薬学的に許容されうる塩を提供する。

本発明の化合物は、選択的ムスカリンM<sub>3</sub>受容体拮抗作用を有しており、副作用が少なく安全で、喘息、慢性気道閉塞、肺繊維症等の呼吸器系疾患、頻尿、尿意切迫感、尿失禁等の排尿障害を伴う泌尿器系疾患、過敏性大腸、消化管の痙攣もしくは運動機能亢進等の消化器系疾患の治療または予防のために有用である。

## 情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願をパンフレット第一頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AL	アルバニア	DE	ドイツ	LI	リヒテンシュタイン	PL	ポーランド
AM	アルメニア	DK	デンマーク	LC	セントルシア	PT	ポルトガル
AU	オーストラリア	EE	エストニア	LK	スリランカ	RO	ルーマニア
AZ	アゼルバイジャン	ES	スペイン	LR	リベリア	RU	ロシア連邦
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	FI	フィンランド	LS	レソト	SD	スーダン
BB	バルバドス	FR	フランス	LT	リトアニア	SE	スウェーデン
BE	ベルギー	GB	イギリス	LU	ルクセンブルグ	SG	シンガポール
BF	ブルキナ・ファソ	GE	グルジア	LV	ラトヴィア	SI	スロベニア
BG	ブルガリア	GN	ギニア	MC	モナコ	SK	スロバキア
BJ	ベナン	GR	ギリシャ	MD	モルドヴァ共和国	SN	セネガル
BR	ブラジル	HU	ハンガリー	MG	マダガスカル	SZ	スワジランド
BY	ベラルーシ	IE	アイルランド	MK	マケドニア共和国	TD	チャド
CA	カナダ	IL	イスラエル	ML	マリ	TG	トーゴ
CG	中央アフリカ共和国	IT	イタリア	MN	モンゴル	TJ	タジキスタン
CH	スイス	JP	日本	MR	モリタニア	TM	トルクメニスタン
CI	コート・ジボワール	KE	ケニア	MW	モザンビーク	TR	トルコ
CN	中国	KG	キルギスタン	MX	メキシコ	TT	トリニダード・トバゴ
CU	キューバ	KP	朝鮮民主主義人民共和国	NE	ニジェール	UA	ウクライナ
CZ	チェコ共和国	KR	大韓民国	NL	オランダ	UG	ウガンダ
		KZ	カザフスタン	NO	ノルウェー	US	アメリカ合衆国
				NZ	ニュージーランド	UZ	ウズベキスタン
						VN	ヴェトナム